

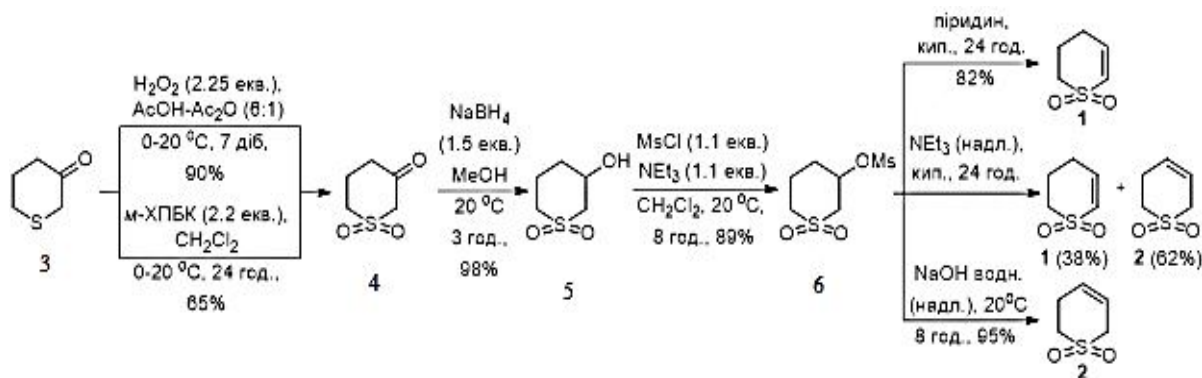
НОВИЙ МЕТОД СИНТЕЗУ 3,4- І 3,6-ДИГІДРО-2H-ТІОПІРАН-1,1-ДІОКСИДІВ

М.С. Іванова, магістр 2-го року навчання спеціальності хімія

Дніпропетровський національний університет ім. Олеся Гончара
49010 Дніпро, пр. Гагаріна, 72

ivanova@cf.dnu.dp.ua

Винахід стосується синтетичної органічної хімії, а саме нового способу синтезу 3,4- і 3,6-дигідро-2H-тіопіран-1,1-діоксидів (**1**) і (**2**), які можуть знайти використання як білдинг-блоки в синтезі фармацевтичних препаратів. На сьогодні серед сполук, що включають дигідро-2H-тіопіран-1,1-діоксидний фрагмент, є такі відомі лікарські засоби, як антиглаукомний препарат Дорзоламід та діуретик Метікран.



Поставлена задача вирішується чотирьохстадійним способом синтезу 3,4- і 3,6-дигідро-2H-тіопіран-1,1-діоксидів виходячи з дигідро-2H-тіопіран-3(4H)-ону. Згідно способу спочатку (**3**) проводять окиснення гідроген пероксидом, потім (**4**) відновлюють кетогрупу борогідридом натрію з наступним мезилуванням (**5**) і відщепленням метансульфоїкислоти (**6**) в основних умовах.

У порівнянні з прототипом способів, що заявляється є простішим, включає більш дешеві та доступні реагенти і приводить до цільових сульфонів з загальними виходами 60% та 78% відповідно. Запропонований спосіб розширяє можливості синтетичних підходів до аналогічних функціоналізованих циклічних сульфонів.

Структури всіх сполук підтверджено за допомогою ПМР – спектроскопії (методи ^1H , ^{13}C , COSY).

Література

1. Fehnel E.A., Thiapyran Derivatives. III. The Preparation, Properties and Reactions of Δ^2 -Dihydrothiapyran 1,1-Dioxide // J. Am. Chem. Soc. 1952. – 74. – P. 1569–1574.